



(19) Europäisches Patentamt

European Patent Office

Office ur péen des brev ts

(20)

## EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 79105052.9

(51) Int. Cl.<sup>3</sup>: C 07 D 249/08

(22) Anmeldetag: 10.12.79

C 07 D 233/56, C 07 D 231/12  
 C 07 D 233/68, C 07 D 411/12  
 C 07 D 401/12, C 07 D 405/12  
 C 07 D 413/12, C 07 D 403/12  
 C 07 D 409/12, A 01 N 43/00  
 // (C07D307/68, C07C103/76,  
 103/175, 103/737, 103/375,  
 103/58, 121/60, C07D333/38,  
 213/81, 261/18, C07C125/065,  
 125/067, C07D263/34)

(30) Priorität: 18.12.78 DE 2854598

(71) Anmelder: BASF Aktiengesellschaft  
Carl-Bosch-Straße 38  
D-6700 Ludwigshafen(DE)(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:  
23.07.80 Patentblatt 80/15(72) Erfinder: Plath, Peter, Dr. Dipl.-Chem.  
Berner Weg 24  
D-6700 Ludwigshafen(DE)(34) Benannte Vertragsstaaten:  
AT BE CH DE FR GB IT LU NL SE(72) Erfinder: Eicken, Karl, Dr. Dipl.-Chem.  
Waldstrasse 63  
D-6706 Wachenheim(DE)(72) Erfinder: Rohr, Wolfgang, Dr. Dipl.-Chem.  
Gontardstrasse 4  
D-6800 Mannheim 1(DE)(72) Erfinder: Zeeh, Bernd, Dr. Dipl.-Chem.  
Thorwaldsenstrasse 5  
D-6700 Ludwigshafen(DE)(72) Erfinder: Pommer, Ernst-Hinrich, Dr.  
Berliner Platz 7  
D-6703 Limburgerhof(DE)

(54) N-substituierte Carbonsäureanilide, Verfahren zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung als Fungizide.

(57) Die vorliegende Erfindung betrifft neue wertvolle  
N-substituierte Carbonsäureanilide, Verfahren zu ihrer Her-  
stellung sowie ihre Verwendung als Fungizide.

BASF Aktiengesellschaft

O.Z. 0050/033579

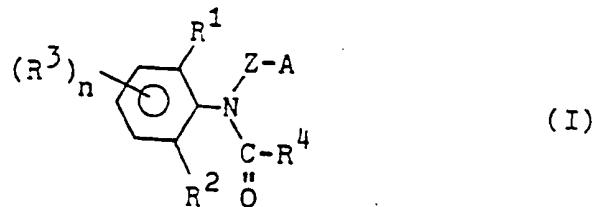
N-substituierte Carbonsäureanilide, Verfahren zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung als Fungizide

Die vorliegende Erfindung betrifft neue wertvolle N-substituierte Carbonsäureanilide, Verfahren zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung als Fungizide.

Es ist bekannt, N-Trichlormethylthio-phthalimid als Fungizid zu verwenden (Chemical Week, 1972, June 21, Seite 63). Außerdem sind N-Azolylmethyl-chloracetanilide als Herbizide bekannt geworden (DE-OS 26 48 008 und DE-OS 27 04 281). Es findet sich kein Hinweis auf eine fungizide Wirkung.

Es wurde nun gefunden, daß neue N-substituierte Carbonsäureanilide der Formel

20



worin

R<sup>1</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy oder Halogen,

25 R<sup>2</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen,

R<sup>3</sup> Methyl oder Chlor,

Sws/BL

<sup>4</sup> R gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Halogen im Phenylring substituiertes Styryl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Benzyl oder 1-Phenyläthyl außer Monohalogenacetyl bedeutet.

5 <sup>4</sup> oder R gegebenenfalls durch Methyl, Fluor, Chlor, Brom, Jod, Cyan, Nitro, Trifluormethyl, Methoxy oder Methylthio, ein- oder zweifach substituiertes Phenyl, oder einen gegebenenfalls durch Methyl oder Halogen substituierten 5- oder 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit 1 oder 2 Heteroatomen bedeutet

10 <sup>4</sup> oder R den Rest -CH<sub>2</sub>-Y oder -CH-Y bedeutet, wobei Y C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Chlor, Methyl oder Trifluormethyl substituiertes Phenoxy oder Phenylthio bedeutet,

15 20 oder R den Rest -X-R<sup>5</sup> bedeutet, wobei X Sauerstoff oder Schwefel und

25 <sup>5</sup> R C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Cyclohexyl oder gegebenenfalls einfacher oder mehrfach durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Methyl, Nitro, Äthyl, Isopropyl, tert.-Butyl, Methoxy oder Methylthio substituiertes Phenyl bedeutet,

30 Z die Reste -CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH- oder

<sup>1</sup> CH<sub>3</sub> -CH-CH<sub>2</sub>- bedeutet,

<sup>1</sup> CH<sub>3</sub>

m 1 oder 2 bedeutet und

35 A gegebenenfalls durch Methyl, Äthyl, Isopropyl, Nitro, Chlor oder Brom einfacher oder mehrfach substituiertes Pyrazol, Imidazol oder 1,2,4-Triazol bedeutet und



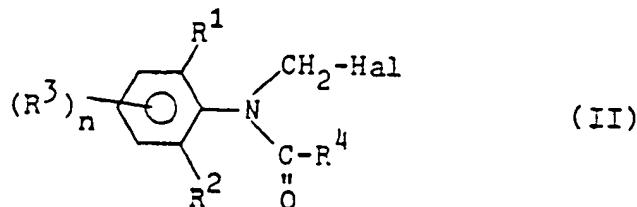
10 n 0, 1 oder 2 bedeutet,

sowie deren Säureadditionsprodukte und Metallsalzkomplexverbindungen eine gute fungizide Wirkung haben.

5

Die Herstellung der neuen Verbindungen kann in der Weise erfolgen, daß man ein N-Halogenmethylcarbonsäureanilid der Formel

10



15

in welcher R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> und n die oben angegebene Bedeutung haben, und Hal Halogen, insbesondere Chlor oder Brom bedeutet, mit Azolen der Formel

20

A-M (III)

in welcher

A die oben angegebene Bedeutung hat und

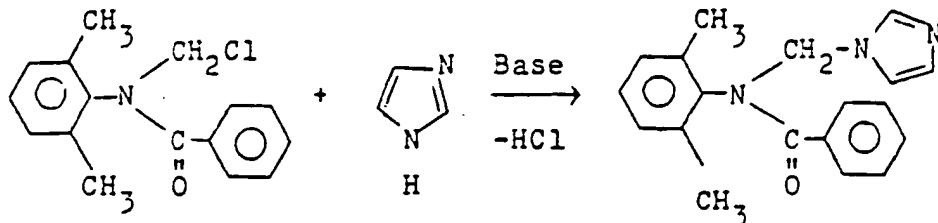
M Wasserstoff oder ein Alkalimetall bedeutet,

25 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt und gegebenenfalls an die so erhaltene Verbindung anschließend eine Säure oder ein Metallsalz addiert.

30

Im Falle der Umsetzung von 2,6-Dimethyl-N-chlormethyl-benzanilid und Imidazol kann der Reaktionsablauf durch das folgende Reaktionsschema wiedergegeben werden:

35



In der Formel I bedeutet  $R^1$  vorzugsweise Methyl oder Äthyl, während  $R^2$  bevorzugt Wasserstoff oder Methyl, Äthyl, Isopropyl, tert.-Butyl oder Chlor bedeutet.  $R^3$  steht für Methyl oder Chlor beispielsweise in 3- und/oder 5-Stellung.

n hat bevorzugt den Wert 0.

Hal steht in Formel II bevorzugt für Chlor, kann jedoch auch für Brom stehen.

$R^4$  in Formel I steht beispielsweise für Methyl, Äthyl, Isopropyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethyl, 1-Chlor-äthyl ( $-\text{CH}-\text{CH}_3$ ), 1,1-Dichloräthyl, Cl

n-Propyl, n-Butyl, tert.-Butyl, tert.-Butylmethyl ( $-\text{CH}_2-\text{C}_4\text{H}_9$  tert.), Cyclohexyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Äthenyl ( $-\text{CH}=\text{CH}_2$ ), 1,2-Dichloräthenyl, 2,2-Dimethyläthenyl

$-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$ , Benzyl, 2-Chlorbenzyl, 3-Chlorbenzyl, 4-Chlorbenzyl, 1-Phenyläthyl ( $-\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_5$ ), Phenyl,

2-Methylphenyl, 3-Methylphenyl, 4-Methylphenyl, 2-Chlorphenyl, 3-Chlorphenyl, 4-Chlorphenyl, 2-Fluorphenyl, 3-Fluorphenyl, 4-Fluorphenyl, 3-Bromphenyl, 3-Cyanphenyl, 2-Nitrophenyl, 3-Nitrophenyl, 4-Nitrophenyl, 3-Trifluormethylphenyl, 4-Trifluormethylphenyl, 2-Methoxy-phenyl, 3-Methoxyphenyl, 4-Methoxyphenyl, 4-Methylthiophenyl, 2-Jodphenyl, 2,3-Dichlor-

phenyl, 2,4-Dichlorphenyl, 2,5-Dichlorphenyl, 2,6-  
 -Difluorphenyl, 3,4,5-Trimethoxyphenyl, 3,5-Dimethyl-  
 phenyl, 3,5-Dichlorphenyl, 2-Phenyläthenyl  
 (C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>-CH=CH-), 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl,  
 5 4-Chlor-thienyl-3, 4,5-Dichlorthienyl-3, Pyridyl-3,  
 2,6-Dichlor-pyridyl-4, 2-Chlor-pyridyl-3, 2,4-Dichlor-  
 pyrimidyl-5, 4-Methyl-oxazolyl-5 oder 3-Methylisoxa-  
 zolyl-5.

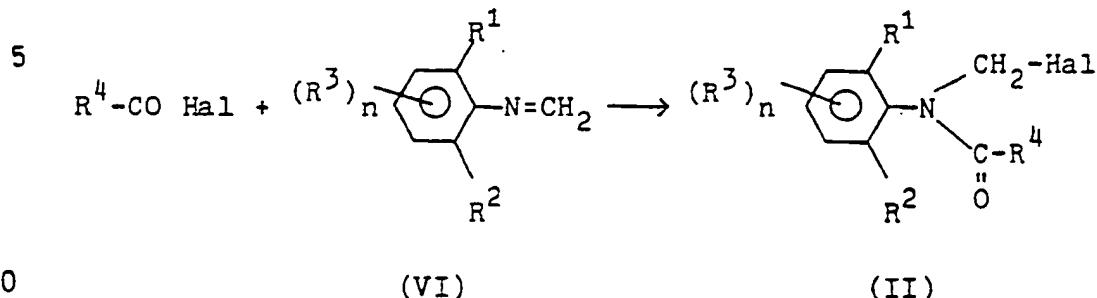
10 R<sup>4</sup> steht außerdem für den Rest -CH<sub>2</sub>-Y oder -CH-Y, wobei Y  
 CH<sub>3</sub>  
 beispielsweise den Rest Methoxy, Äthoxy, Isopropoxy,  
 Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Benzyloxy, Methylthio,  
 Phenylthio, 4-Chlorphenylthio, Phenoxy, 2,4-Dichlor-  
 15 phenoxy, 2-Chlorphenoxy, 3-Chlorphenoxy, 4-Chlorphenoxy  
 bedeutet.

10 R<sup>4</sup> steht außerdem für den Rest -X-R<sup>5</sup>, wobei X für Sauer-  
 20 stoff oder Schwefel und R<sup>5</sup> beispielsweise für Methyl,  
 Äthyl, Isopropyl, sek.-Butyl, iso-Butyl, tert.-Butyl,  
 Cyclohexyl, Phenyl, 4-Fluorphenyl, 2-Chlorphenyl,  
 3-Chlorphenyl, 2,4-Dichlorphenyl, 2-Methyl-phenyl,  
 2-Methyl-4-tert.-butylphenyl, 2-Methyl-4-chlorphenyl,  
 25 2,3-Dichlorphenyl, 2-Chlor-5-methoxyphenyl, 2,6-Di-  
 methoxyphenyl, 3,5-Dimethoxyphenyl, 3,5-Dichlorphenyl,  
 3-Trifluormethyl-phenyl, 2,3-Dibromphenyl, 4-Nitro-  
 phenyl, 4-Isopropylphenyl, 4-tert.-Butylphenyl,  
 4-Methylthiophenyl steht.

30 Für Z steht bevorzugt die Methylengruppe -CH<sub>2</sub>-, jedoch  
 kann Z auch für -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-; -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-; -CH<sub>2</sub>-CH- oder für  
 -CH-CH<sub>2</sub>- stehen.  
 CH<sub>3</sub>

35

Die Herstellung der N-Halogenmethylcarbonsäureanilide der Formel II erfolgt durch Addition eines Säurehalogenids  $R^4-CO-Hal$  an eine Schiff'sche Base der Formel VI:



wobei Hal Halogen bedeutet und  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  und n die oben genannten Bedeutungen haben.

15 Diese Verfahrensvariante ist Gegenstand der US-Patentschriften 3 630 716 und 3 637 847 und der DE-OS 15 42 950, sofern  $R^4$ -CO Hal ein Säurehalogenid einer Benzoësäure oder einer Alkancarbonsäure ist.

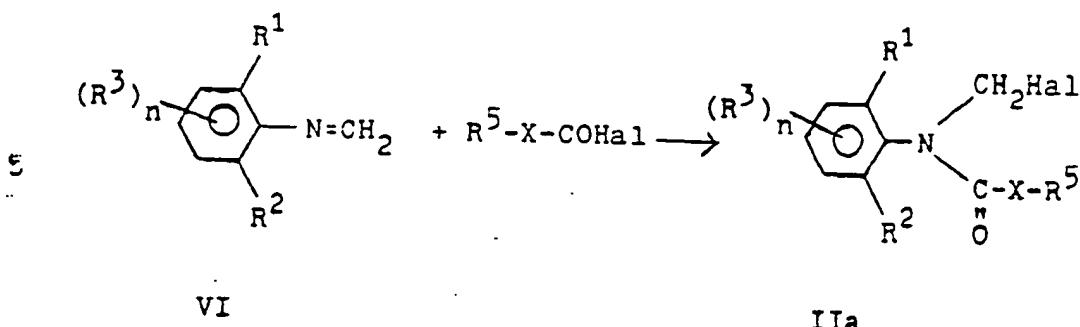
20 Die US-Patentschriften 3 714 299 und 3 810 981 beschreiben ferner Verbindungen der Formel II, in denen  $R^4$  ein Alkoxy-, ein Alkoxyalkyl-, Alkenyl- oder Cycloalkylrest ist.

25 Ferner wird in der deutschen Offenlegungsschrift 21 19 518 die Herstellung von N-Aryl-N-chlormethylcarbamaten durch Chlormethylierung von N-Arylcaramaten beschrieben, wobei ausdrücklich betont wird, daß nach dem dort beschriebenen Verfahren auch Verbindungen der Formel IIa (s.u.) erhältlich sind, die nicht durch Addition von Chlorkohlen-

30 säure-O-arylestern an Hexahydrotriazine (= Trimere Schiff'sche Basen) zugänglich seien. Wie in den folgenden Beispielen gezeigt wird, gelingt jedoch die Addition von Chlorkohlensäure-estern auch dann gut an 2,6-Dialkyl-N-methylenaniline VI, wenn es sich um Chlorkohlensäure-O-arylester handelt. Die Umsetzung erfolgt gemäß folgendem

35

Séchena.



K In den zitierten Patentschriften wird nicht die Umsetzung heterocyclischer Carbonsäurehalogenide mit Schiff'schen Basen der Formel VI beschrieben. Diese Reaktion gelingt jedoch ebenfalls mit sehr guten Ausbeuten, wie die folgenden Beispiele zeigen.

15

### Beispiel a

315 Raumteile einer Toluol-Lösung, die 1 Mol 2,6-Dimethyl-phenylazomethin enthält, (Herstellung US-PS 3 637 847) wurden unter Röhren bei 5 bis 10°C zu einer Lösung von 130,5 Gewichtsteilen 2-Furancarbonsäurechlorid in 100 Raumteilen Toluol unter Kühlung zugetropft und anschließend 10 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Nach dem Kühlen, Absaugen und Trocknen im Vakuum erhielt man 198 Gewichtsteile N-Chlormethylfuran-2-carbonsäure-2',6'-dimethylanilid vom Schmelzpunkt 124-126°C

30 Obwohl die Umsetzung von z.B. Benzoylchlorid mit 2,6-Di-  
methyl-N-methylenanilin in den zitierten US-Patentschrif-  
ten beansprucht wird, ist in der Literatur keine Angabe  
über Eigenschaften von und Umsetzungen mit N-Chlormethyl-  
-2,6-dimethyl-N-benzoyl-anilin zu finden. Eines der fol-  
genden Beispiele zeigt diese Umsetzung. Die als Ausgangs-  
35 produkte benötigten N-Chlormethyl-carbonsäureanilide sind  
in der folgenden Tabelle I aufgeführt.

5

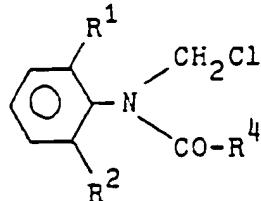
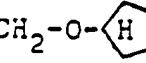
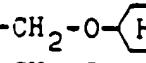
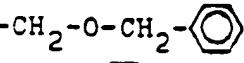
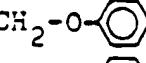
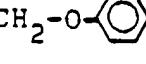
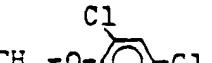
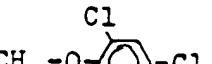
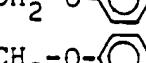
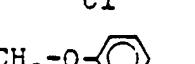
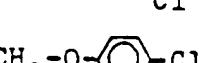
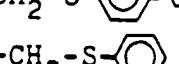
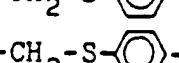


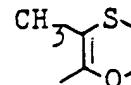
Tabelle I

Lfd. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	Physikalische Konstanten
10	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	viskose Masse
11	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	viskose Masse
12	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	Ø1
13	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Ø1
14	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	Ø1
15	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Ø1
16	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Ø1
17	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHCl <sub>2</sub>	102-104°C
18	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHCl <sub>2</sub>	88-90°C
19	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CHCl <sub>2</sub>	
20	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CCl <sub>3</sub>	Ø1
21	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CCl <sub>3</sub>	
22	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CCl <sub>3</sub>	
23	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHCl-CH <sub>3</sub>	95°C
24	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	75-76°C
25	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -tert	Ø1
26	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cyclopropyl	82°C
27	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cyclopropyl	Ø1
28	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cyclopropyl	Ø1
29	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cyclohexyl	97-100°C
30	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Benzyl	62-64
31	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Benzyl	
32	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Benzyl	
33	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> tert.	n <sub>D</sub> <sup>30</sup> = 1,5165
34	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> -	
35	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	70°C

Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	Physikalische Konstanten
5	26	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
	27	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
	28	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>
	29	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>
	30	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>
	31	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -O-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
10	32	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> -O-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i
	33	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -O- 
	34	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -O- 
	35	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -S-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i
15	36	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> - 
	37	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -O- 
	38	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> -O- 
	39	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -O-  -Cl
20	40	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> -O-  -Cl
	41	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -O-  -Cl
	42	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -O-  -Cl
25	43	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -O-  -Cl
	44	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -S- 
	45	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -S-  -Cl
	46	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CCl <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>
30	47	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-2-Chlorbenzyl
	48	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-Chlorbenzyl
	49	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	$\alpha$ -Phenyläthyl
	50	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	$\alpha$ -Phenyläthyl
				$n_D^{23} = 1,5547$

Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	Physikalische Konstanten	
	51	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	$\alpha$ -(2-Chlorphenyl)-äthyl	
5	52	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	$\alpha$ -(2-Chlorphenyl)-äthyl	
	53	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Chlorbenzyl	
	54	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH=CH <sub>2</sub>	
	55	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH=CH-CH <sub>3</sub>	
10	56	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH=CH- 	$n_{D}^{23} = 1,6053$
	57	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CCl=CHCl	
	58	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		-CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	59	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Phenyl	Fp. 133°C
	60	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Phenyl	
15	61	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Phenyl	Fp. 98-99°C
	62	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	Phenyl	Fp. 107-108°C
	63	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-Methylphenyl	Fp. 118-119°C
	64	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-Methylphenyl	Fp. 133-135°C
	65	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Methylphenyl	Fp. 119-120°C
20	66	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-Chlorphenyl	Fp. 93°C
	67	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-Chlorphenyl	Fp. 145°C
	68	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Chlorphenyl	
	69	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Chlorphenyl	Fp. 126°C
	70	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Chlorphenyl	
25	71	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-Fluorphenyl	Fp. 86-88°C
	72	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Fluorphenyl	
	73	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-Fluorphenyl	Fp. 114-115°C
	74	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Fluorphenyl	Fp. 141-143°C
	75	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-Bromphenyl	
30	76	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-Jodphenyl	
	77	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-Cyanphenyl	Fp. 116-118°C
	78	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Cyanphenyl	Fp. 112-114°C
	79	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-Nitrophenyl	Fp. 205-207°C
	80	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Nitrophenyl	
35	81	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-Nitrophenyl	Fp. 152-154°C

Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	Physikalische Konstanten
82	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Nitrophenyl	Fp. 118-120°C
83	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Trifluormethyl-phenyl	Fp. 63-64°C
84	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Trifluormethyl-phenyl	Fp. 108-109°C
85	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-Methoxyphenyl	
86	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-Methoxyphenyl	Fp. 107-108°C
87	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Methoxyphenyl	Fp. 92-93°C
88	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Methyl-thio-phenyl	
89	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2,3-Dichlorphenyl	
90	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,3-Dichlorphenyl	
91	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Dichlorphenyl	Fp. 68-69°C
92	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2,4-Dichlorphenyl	Fp. 108°C
93	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,5-Dichlorphenyl	
94	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3,5-Dichlorphenyl	
95	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3,5-Dimethyl-phenyl	
96	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2,6-Difluorphenyl	
97	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Furyl-2	Fp. 124-126°C
98	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Furyl-2	Fp. 69-70°C
99	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Furyl-3	
100	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Furyl-3	
101	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2,5-Dimethyl-furyl-3	in Lsg. direkt weiterverarbeitet
102	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,5-Dimethyl-furyl-3	
103	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Thienyl-2	Fp. 94-97°C
104	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Thienyl-2	
105	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Thienyl-3	als Toluol-Lösung weiterverarbeitet
106	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Chlorthienyl-3	Fp. 118°C
107	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4,5-Dichlorthienyl-3	

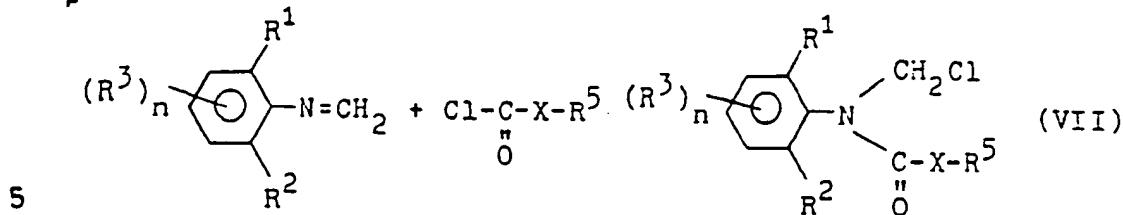
Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	Physikalische Konstanten
108	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Pyridyl-3	
109	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-Chlorpyridyl-3	
5 110	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Chlorpyridyl-3	
111	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2,6-Dichlorpyridyl-4-	
112	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,6-Dichlorpyridyl-4-	Fp. 79-80°C
10 113	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2,4-Dichlorpyridyl-5	
114	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		
15 115	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		
116	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	Thienyl-2	Fp. 94-95°C
117	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	2,6-Difluorphenyl	Fp. 135°C
118	H	H	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Öl
119	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -Cl	Öl
20 120	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-Methyl-isoxazolyl-5	Fp. 106°C
121	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Methyl-oxazolyl-5	Fp. 83-85°C
122	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Methyl-isoxazolyl-5	Fp. 86-88°C

25

Als Beispiele für die Ausgangsstoffe der Formel II seien weiterhin folgende N-Chlormethyl-N-Arylcaramate der Formel VII genannt, die nach folgendem Schema hergestellt wurden:

30

35



wobei  $n$ ,  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ ,  $\text{R}^5$  und  $\text{X}$  die angegebene Bedeutung hat.  
 $n = 0$ .

10 Tabelle II

	Lfd. Nr.	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^5$	$\text{X}$	Physikalische Konstante
15	123	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	0	01
	124	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{CH}_3$	0	01
	125	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	0	01
	126	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	0	01
	127	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_7\text{-i}$	0	
	128	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{CH}_3\text{C}_2\text{H}_7\text{-i}$	0	
20	129	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{n-C}_4\text{H}_9$	0	
	130	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{sek.}-\text{C}_4\text{H}_9$	0	
	131	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{iso-C}_4\text{H}_9$	0	
	132	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{tert-C}_4\text{H}_9$	S	
	133	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{CH}_3$	S	
25	134	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	Phenyl	S	
	135	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	Cyclohexyl	0	
	136	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	Phenyl	0	Fp. 113-115°C
	137	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	Phenyl	0	Fp. 94-95°C
	138	$\text{C}_3\text{H}_7\text{-i}$	$\text{C}_3\text{H}_7\text{-i}$	Phenyl	0	Fp. 115-116°C
30	139	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	4-Fluorphenyl	0	
	140	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	2-Chlorphenyl	0	
	141	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	2,4-Dichlorphenyl	0	
	142	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	2,3-Dichlorphenyl	0	
	143	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	3-Chlorphenyl	0	
35	144	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	4-Chlorphenyl	0	

Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>5</sup>	x	Physikalische Konstante
145	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Methyl-4-chlor-phenyl	0	
5 146	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Chlor-5-methoxyphenyl	0	
147	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,6-Dimethoxy-phenyl	0	
148	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,5-Dimethoxy-phenyl	0	
10 149	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3,5-Dichlor-phenyl	0	
150	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Trifluor-methyl-phenyl	0	
151	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,3-Dibrom-phenyl	0	
15 152	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Nitrophenyl	0	
153	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Isopropyl-phenyl	0	
154	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-tert.-Butyl-phenyl	0	
20 155	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Methylthio-phenyl	0	
156	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Methylphenyl	0	
157	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-Methylphenyl	0	

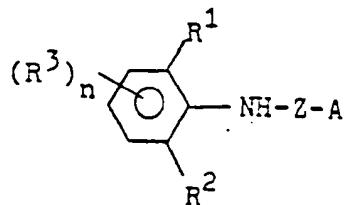
25 Die außerdem als Ausgangsstoffe benötigten Schiff'schen Basen der Formel VI lassen sich nach bekannten Methoden (z.B. US 3 637 847) aus entsprechenden Anilinen und Para-formaldehyd in Toluol herstellen.

30 In Formel I steht A vorzugsweise für die Azolylreste Pyrazolyl-1, Imidazolyl-1, 1,2,4-Triazolyl-1, 2-Methyl-imidazolyl-1, 2-Äthyl-imidazolyl-1, 2-Isopropyl-imidazolyl-1, 4-Nitro-pyrazolyl-1, 4-Chlor-pyrazolyl-1, 4-Brom-pyrazolyl-1, 4,5-Dichlorimidazolyl-1, 2,4,5-Trimethyl-imidazolyl-1 und 3,5-Dimethyl-pyrazolyl-1.

M steht in Formel III vorzugsweise für Wasserstoff, Natrium oder Kalium. Die Verbindungen der Formel III sind allgemein bekannte Verbindungen der organischen Chemie.

5 Die ebenfalls als Ausgangsstoffe benötigten sek. Aniline der Formel IV werden durch diese Formel allgemein definiert. Ihre Herstellung gelingt nach allgemein bekannten Methoden der organischen Chemie. Bevorzugte Beispiele für diese sek. Aniline sind in der folgenden Tabelle angegeben; ihre Herstellung wird in den Beispielen erläutert.

15



n = 0

20

Tabelle III

	Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z	A	Physikalische Konstante
25	158	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - CH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol	K <sub>p</sub> <sub>0,2</sub> = 145°C
	159	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - CH <sub>3</sub>	Imidazol	
	160	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	Pyrazol	K <sub>p</sub> <sub>0,05</sub> = 123- 126°C
30	161	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	Pyrazol	K <sub>p</sub> <sub>0,3</sub> = 145- 150°C
	162	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH- CH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol	

35

10 Für die Herstellungsverfahren kommen als Verdünnungsmittel vorzugsweise Toluol oder Essigsäureäthylester infrage.

15 Es können jedoch auch andere (unter den Reaktionsbedingungen inerte) Lösungsmittel wie Diäthylketon, Propionitril, Acetonitril, Tetrahydrofuran, Dioxan, Xylol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol oder Dimethylformamid verwendet werden.

10 Als Säurebindemittel können anorganische Säureakzeptoren wie Alkalicarbonate, beispielsweise  $\text{Na}_2\text{CO}_3$ ,  $\text{K}_2\text{CO}_3$  oder  $\text{NaHCO}_3$  oder tertiäre Amine, wie beispielsweise Triäthylamin, Dimethyl-benzylamin oder Pyridin verwendet werden. Es ist auch möglich, die entsprechenden Azole im Überschuss einzusetzen.

15 15 Die Reaktionstemperaturen können zwischen -10 und 150°C variiert werden, bevorzugt wird der Bereich zwischen 20 bis 120°C.

20 20 Bei der Herstellung der neuen Verbindungen setzt man auf 1 Mol der Verbindungen der Formel II vorzugsweise 1 bis 2 Mol des Azols der Formel III und 1 Mol Säurebinder ein, beziehungsweise auf 1 Mol der Verbindungen gemäß Formel IV vorzugsweise 1 bis 1,2 Mol Carbonsäurehalogenid der Formel V und 1,1 bis 1,3 Mol Säurebinder.

25 Zur Isolierung der Verbindungen der Formel I wird das Reaktionsgemisch beispielsweise filtriert, das Filtrat mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls durch fraktionierte Kristallisation oder Destillation gereinigt.

30 35 Zur Herstellung von Säureadditionssalzen der Verbindungen der Formel I kommen bevorzugt physiologisch verträgliche Säuren infrage, beispielsweise Chlorwasserstoffsäure,

0013360

ortho-Phosphorsäure, Salpetersäure, Maleinsäure, Zitronensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfinsäure, Methansulfinsäure.

5 Zur Herstellung derartiger Salze bedient man sich der üblichen Methoden, beispielsweise Lösen der Verbindung nach Formel I in einem inerten Lösungsmittel wie Toluol, und anschließende Zugabe der Säure, Abfiltrieren, Isolieren und gegebenenfalls Reinigung durch Umkristallisieren.

10 Zur Herstellung von Metallsalz-Komplexverbindungen der Verbindungen der Formel I kommen vorzugsweise die Chloride oder Nitrate von Magnesium, Kupfer, Eisen, Mangan oder Nickel infrage. Man löst die Metallsalze in Athanol und fügt anschließend die äquivalente Menge (oder weniger) der Verbindung der Formel I zu, isoliert das Komplexsalz durch Filtration und reinigt gegebenenfalls durch Umkristallisieren.

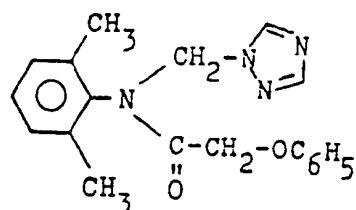
15

15

Beispiel 1

20

$(C_{19}H_{20}N_4O_2)$



25

1. Zu einer Lösung von 34,1 g (0,2 Mol) Phenoxyacetylchlorid in 50 ml Ligroin tropft man langsam bei 0 bis 5°C eine Lösung von 26,6 g (0,2 Mol) N-Methylen-2,6-dimethylanilin in 100 ml Toluol. Nach 16-stündigem Rühren bei Raumtemperatur wird vom ausgefallenen Produkt abgesaugt. Man isoliert nach Trocknen im Vakuum 47 g N-Chlormethyl-2,6-dimethyl-phenoxyacetanilid (78 % Ausbeute), Fp. 87°C.

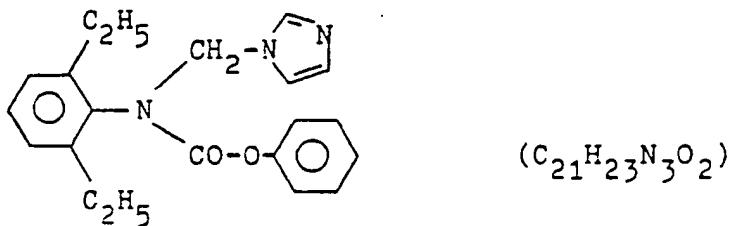
35

2. Man suspendiert 10,7 g (155 mMol) 1,2,4-Triazol in 100 ml Toluol und versetzt mit 23,5 g (77,5 mMol) N-Chlormethyl-2,6-dimethyl(phenoxyacetyl)anilid. Anschließend erhitzt man 1 Stunde auf 130°C, so daß die Reaktionsmischung zum Sieden kommt. Nach dem Abkühlen wird filtriert, mit Toluol nachgewaschen und das Filtrat eingeengt. Der Filterrückstand wird verworfen. Man erhält nach dem Trocknen 17 g eines farblosen Feststoffs (65 % d.Th.) mit Schmelzpunkt 84°C.

10

Beispiel 2

15



20

1. Zu einer Lösung von 31,3 g (0,2 Mol) Chlorameisen-säurephenylester in 100 ml Ligroin gibt man bei 15 bis 20°C unter leichter Kühlung eine Lösung von

25 32,2 g (0,2 Mol) N-Methylen-2,6-diäthylanilin in 50 ml Ligroin. Nach 16-stündigem Rühren isoliert man

nach Absaugen und Trocknen 49,2 g (76 %) N-Chlor-

30 methyl-N-2,6-diäthylphenyl-carbaminsäure-O-phenyl-ester vom Schmelzpunkt 94-95°C.

2. 20 g (63 mMol) des obigen N-Chlormethylcarbamates werden in 100 ml Toluol mit 8,6 g (126 mMol) Imida-

35 zol gemischt; anschließend wird die Reaktionsmischung 1 Stunde zum Sieden erhitzt. Das Reaktionsgemisch wird anschließend noch heiß filtriert. Das nach dem Ein-

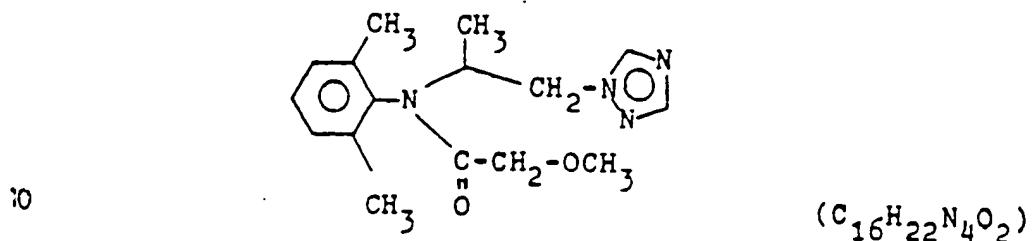
engen des Lösungsmittels verbleibende Öl wird nach Anreiben mit Ligroin kristallin. Nach Absaugen und

35 Trocknung erhält man 13,9 g (63 % d.Th.) N-Imidazolyl-

methyl-N-2,6-diethylphenyl-carbaminsäure-O-phenyl-  
ester vom Schmelzpunkt 115 bis 116°C.

Beispiel 3

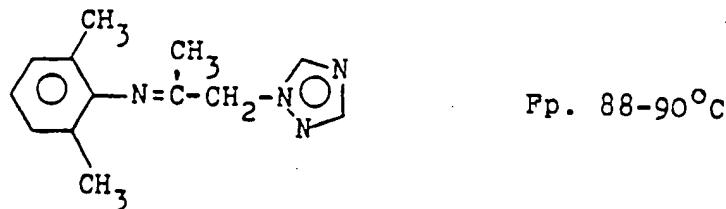
5



Man mischt 25,8 g (0,213 Mol) 2,6-Dimethylanilin mit  
34,8 g (0,23 Mol) 1,2,4-Triazolylaceton (dargestellt durch  
Kochen von 1,2,4-Triazol mit überschüssigem Chloraceton),  
15 in 250 ml Toluol, versetzt mit einer Spatelspitze  
p-Toluol-sulfonsäure und erhitzt 2 Stunden zum Sieden.

20 Während dieser Zeit wird das Reaktionswasser am Wasser-  
abscheider aufgefangen. Nach Einengen und Umkristallisa-  
tion des Rückstands aus Äthanol erhält man die Verbindung

25

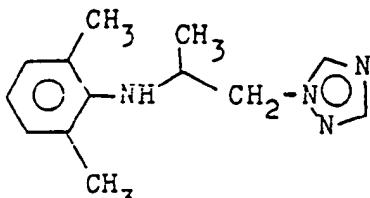


22,8 g (0,1 Mol) dieser Schiff'schen Base werden in 150 ml  
Methanol gelöst und portionsweise bei 0 bis 10°C mit  
30 14,4 g (0,3 Mol) NaBH<sub>4</sub> versetzt. Nach 1 Stunde Rühren wird  
1 Std. zum Sieden erhitzt, danach wird eingeeengt, der  
Rückstand mit 100 ml Wasser versetzt und 3 x mit 150 ml  
Methylenchlorid extrahiert. Nach Trocknen und Einengen  
des CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>-Extrakts erhält man das Produkt

35

L

5


 $\delta_1, n_D^{22} = 1,5588$ 

23 g (0,092 Mol) des so dargestellten sek. Anilins werden in 100 ml Toluol gelöst und mit 10,6 g wasserfreiem Natriumcarbonat versetzt. Anschließend wird tropfenweise mit 11 g (0,102 Mol) Methoxyacetylchlorid versetzt und dabei auf 10°C gekühlt. Nach 16 Stunden Rühren wird mit 100 ml H<sub>2</sub>O versetzt, die organische Phase wird abgetrennt, mit 0,5 N-HCl gewaschen, mit NaHCO<sub>3</sub>-Lösung entsäuert, mit H<sub>2</sub>O gewaschen, über Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> getrocknet und eingeeengt. Das erhaltene Öl wurde nach Anreiben mit Petroläther kristallin. Fp. 106°C.

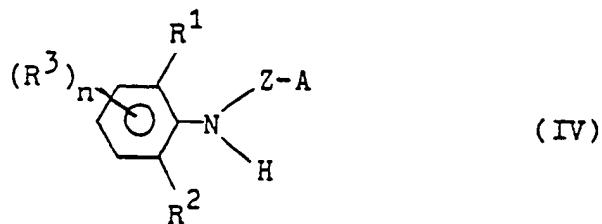
20

In entsprechender Weise sind die in Tabelle IV zusammengefaßten Produkte der Formel I erhalten worden, wobei die Substanzen aus Herstellungsbeispiel 1 und 2 nochmals mit aufgelistet wurden.

25

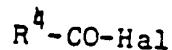
Die Herstellung der neuen N-Azolylalkylcarbonsäureanilide der Formel I, wobei Z den Rest -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>, -CH-CH<sub>2</sub>- oder -CH<sub>2</sub>-CH- bedeutet, erfolgt in der Weise, daß man ein sekundäres Anilin der Formel

30



35

in welcher R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, A, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben, mit einem Carbonsäurehalogenid der Formel



(V)

gegebenenfalls in einem Lösungsmittel umsetzt, wobei Hal Halogen, insbesondere Fluor, Chlor oder Brom bedeutet und

$R^4$  die oben angegebene Bedeutung hat.

Diese Umsetzung erfolgt bevorzugt in Toluol, kann jedoch auch in Diäthyläther, Tetrahydrofuran oder Chloroform erfolgen.

Die bevorzugte Reaktionstemperatur liegt im Bereich von 10 bis 20°C.

Mit 1 Mol der Verbindung IV setzt man bevorzugt 1,0 bis 1,2 Mol der Verbindung V gegebenenfalls von 1,1 bis 1,3 Mol Säurebindemittel um.

20

25

30

35

Tabelle IV n = 0

Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z	R <sup>4</sup>	A	Physikalische Konstante (Fp. °C)
5						
163	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Pyrazol	92
164	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol	100
165	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Imidazol	
166	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Imidazol	81
167	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol	81
10	168	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Pyrazol	61
	169	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Imidazol	81
	170	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	1,2,4-Triazol	81
	171	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Imidazol	81
	172	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1,2,4-Triazol	103
15	173	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Imidazol	81
	174	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	1,2,4-Triazol	68
	175	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Imidazol	81
	176	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	1,2,4-Triazol	80
	177	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Pyrazol	95
				C1		
20	178	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Imidazol	119
	179	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	1,2,4-Triazol	131
	180	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH-CH <sub>3</sub>	
	181	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CHCl <sub>2</sub>	Pyrazol 98
	182	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CHCl <sub>2</sub>	Imidazol 118-121
25	183	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CHCl <sub>2</sub>	1,2,4-Triazol 133
	184	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-CHCl <sub>2</sub>	5,5-Dimethylpyrazol 124
	185	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Pyrazol	57-59
	186	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Imidazol	121
	187	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	1,2,4-Triazol	96
30	188	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Imidazol	108
	189	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	1,2,4-Triazol	87
				CCl <sub>3</sub>		

Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z	R <sup>4</sup>	A	Physikalische Konstante (Fp. °C)
5	190 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Pyrazol	
	191 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Pyrazol	K <sub>P0,1</sub> = 135
	192 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>	CHCl <sub>2</sub>	Pyrazol	94-96
10	193 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -CHCl <sub>2</sub>	1,2,4-Triazol	76
	194 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol	128
15	195 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	Pyrazol	106
	196 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	Imidazol	91-94
	197 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol	110
	198 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1,2,4-Triazol	57-59
	199 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1,2,4-Triazol	
20	200 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	1,2,4-Triazol	
	201 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	Imidazol	
	202 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-O- 	Pyrazol	91-92
25	203 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-O- 	Imidazol	Harz
	204 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-O- 	1,2,4-Triazol	112-114
	205 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-O- 	Pyrazol	
	206 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-O- 	Imidazol	115-116
30	207 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-O- 	1,2,4-Triazol	81
	208 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Fluor-phenoxy	1,2,4-Triazol	
	209 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Chlor-phenoxy	1,2,4-Triazol	
35	210 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Cl-phenoxy	1,2,4-Triazol	
	211 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Cl-phenoxy	1,2,4-Triazol	
	212 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>3</sub> -phenoxy	1,2,4-Triazol	
40	213 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	3-CH <sub>3</sub> -phenoxy	1,2,4-Triazol	

0013360

BASF Aktiengesellschaft

- 24 -

O.Z. 0050/033579

Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z	R <sup>4</sup>	A	Physikalische Konstante (Fp. °C)	
5	214	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -phenoxy	1,2,4-Triazol	
	215	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub> -phenoxy	1,2,4-Triazol	
	216	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>3</sub> -4Cl-phenoxo	1,2,4-Triazol	
10	217	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Cl-5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -phenoxy	1,2,4-Triazol	
	218	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,6-Dimethoxy-phenoxy	1,2,4-Triazol	
	219	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	3,5-Dimethoxy-phenoxy	1,2,4-Triazol	
	220	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub> -phenoxo	1,2,4-Triazol	
15	221	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub> -phenoxy	1,2,4-Triazol	
	222	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,3-Br <sub>2</sub> -phenoxo	1,2,4-Triazol	
	223	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	4-NO <sub>2</sub> -phenoxy	1,2,4-Triazol	
	224	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	4-(C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i)-phenoxy	1,2,4-Triazol	
20	225	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	4-(C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -tert.)-phenoxy	1,2,4-Triazol	
	226	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	4-(CH <sub>3</sub> -S-)-phenoxy	1,2,4-Triazol	
25	227	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-S-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -tert.	1,2,4-Triazol	
	228	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-S-CH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol	
	229	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-S- 	1,2,4-Triazol	
	230	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-O- 	1,2,4-Triazol	
30	231	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-O-CH <sub>2</sub> - 	1,2,4-Triazol	
	232	H	H	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Pyrazol	84
	233	H	H	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol	76
	234	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Pyrazol	113

Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z	R <sup>4</sup>	A	Physikalische Konstante (Fp. °C)
5	235	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Imidazol
	236	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol
	237	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Pyrazol
	238	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Imidazol
	239	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol
	240	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>	Pyrazol
10	241	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>	Imidazol
	242	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol
	243	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>	Pyrazol
	244	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol
	245	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Cyclopropyl	Pyrazol
	246	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Cyclopropyl	1,2,4-Triazol
15	247	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Cyclopropyl	1,2,4-Triazol
	248	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Cyclopropyl	Pyrazol
	249	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Cyclopropyl	Imidazol
	250	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Cyclopropyl	1,2,4-Triazol
	251	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Benzyl	Imidazol
	252	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Benzyl	1,2,4-Triazol
20	253	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Benzyl	1,2,4-Triazol
	254	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -tert. Imidazol	81
	255	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -tert.	1,2,4-Triazol
	256	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -O-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1,2,4-Triazol
	257	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	1,2,4-Triazol
	258	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -O- 	1,2,4-Triazol
25	259	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -O- 	1,2,4-Triazol
	260	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -S-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	1,2,4-Triazol
	261	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> - 	1,2,4-Triazol
	262	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -O- 	Pyrazol
	263	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -O- 	Imidazol
						84

Lfd. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	z	R <sup>4</sup>	A	Physikalische Konstante (Fp. °C)
5	264	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -O- 	1,2,4-Triazol
	265	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -O- 	1,2,4-Triazol
	266	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -O- 	Imidazol
	267	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -O- 	1,2,4-Triazol
10	268	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -O- 	Pyrazol
	269	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -O- 	Imidazol
	270	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -O- 	4,5-Dichlorimidazol
	271	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -O- 	1,2,4-Triazol
15	272	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -O- 	1,2,4-Triazol
	273	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -O- 	1,2,4-Triazol
	274	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -O- 	1,2,4-Triazol
	275	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -S- 	1,2,4-Triazol
20	276	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -S- 	1,2,4-Triazol
	277	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CCl <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol
	278	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH- 	1,2,4-Triazol
	279	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH- 	1,2,4-Triazol
25	280	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH- 	1,2,4-Triazol
	281	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH- 	1,2,4-Triazol
	282	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Chlorbenzyl	1,2,4-Triazol

0013369

Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	z	R <sup>4</sup>	A	Physikalische Konstante (Sp. °C)
5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Chlorbenzyl	1,2,4-Triazol	
283	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Chlorbenzyl	1,2,4-Triazol	
284	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	Imidazol	
285	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	1,2,4-Triazol	70
286	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	1,2,4-Triazol	68
287	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> tert.	Imidazol	76
288	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> tert.	1,2,4-Triazol	109
289	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Cyclohexyl	Imidazol	102
10	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Cyclohexyl	1,2,4-Triazol	123-125
290	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Phenyl	Pyrazol	123-125
291	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Phenyl	Imidazol	128
292	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Phenyl	1,2,4-Triazol	128
293	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Phenyl	Pyrazol	135
294	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Phenyl	Imidazol	138
15	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Phenyl	4,5-Dichlorimi- dazol	133
295	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Phenyl	1,2,4-Triazol	134
296	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Phenyl	4,5-Dichlorimi- dazol	134
297	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Phenyl	1,2,4-Triazol	113-115
298	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Phenyl	4,5-Dichlorimi- dazol	134
20	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Methylphenyl	Imidazol	139-140
300	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Methylphenyl	1,2,4-Triazol	190-192
301	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Methylphenyl	Pyrazol	183-184
302	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Methylphenyl	Imidazol	
303	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Methylphenyl	1,2,4-Triazol	
304	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Methylphenyl	Imidazol	
305	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Methylphenyl	Imidazol	180
25	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Methylphenyl	1,2,4-Triazol	162-165
306	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Chlorphenyl	1,2,4,-Triazol	
307	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Chlorphenyl	Imidazol	151
308	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Chlorphenyl	1,2,4-Triazol	114-116
309	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Chlorphenyl	Imidazol	155-156
310	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Chlorphenyl	1,2,4-Triazol	131-132
30	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Fluorophenyl	Imidazol	147-149
311	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Fluorophenyl	1,2,4-Triazol	117-120
312	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Fluorophenyl	Imidazol	
313	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Fluorophenyl	1,2,4-Triazol	

	Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z	R <sup>4</sup>	A	Physikalische Konstante (Fp. °C)
5	314	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Fluorphenyl	Imidazol	105-108
	315	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Fluorphenyl	1,2,4-Triazol	122-124
	316	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Fluorphenyl	Imidazol	138-139
	317	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Fluorphenyl	1,2,4-Triazol	104-105
	318	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Bromphenyl	1,2,4-Triazol	
10	319	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Jodphenyl	Pyrazol	211-212
	320	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Jodphenyl	Imidazol	154-155
	321	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Jodphenyl	1,2,4-Triazol	222-223
	322	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Cyanphenyl	Imidazol	104-106
	323	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Cyanphenyl	1,2,4-Triazol	147-149
15	324	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Cyanophenyl	Imidazol	116-118
	325	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Cyanophenyl	1,2,4-Triazol	126-128
	326	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Nitrophenyl	Imidazol	127-129
	327	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Nitrophenyl	1,2,4-Triazol	175-180
	328	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Nitrophenyl	Imidazol	
20	329	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Nitrophenyl	1,2,4-Triazol	
	330	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Nitrophenyl	Imidazol	146-148
	331	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Nitrophenyl	1,2,4-Triazol	113-115
	332	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Nitrophenyl	Imidazol	97-100
	333	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Nitrophenyl	1,2,4-Triazol	117-120
25	334	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub> -phenyl	Imidazol	88-90
	335	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub> -phenyl	1,2,4-Triazol	95-97
	336	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub> -phenyl	Imidazol	200-202
	337	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub> -phenyl	1,2,4-Triazol	160-163
	338	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -phenyl	Pyrazol	145
30	339	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -phenyl	Imidazol	119
	340	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -phenyl	1,2,4-Triazol	163
	341	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -phenyl	4,5-Dichlorimidazol	120
	342	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -phenyl	Imidazol	
	343	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -phenyl	1,2,4-Triazol	
35	344	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2,6-Difluor-phenyl	1,2,4-Triazol	
	345	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	CH <sub>2</sub>	2,6-Difluor-phenyl	1,2,4-Triazol	165-167

	Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z	R <sup>4</sup>	A	Physikalische Konstante (Fp. °C)
5	346	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	CH <sub>2</sub>	2,6-Difluor-phenyl	Imidazol	134-135
	347	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	CH <sub>2</sub>	Phenyl	Imidazol	125
	348	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	CH <sub>2</sub>	Phenyl	1,2,4-Triazol	130-132
	349	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol	58
	350	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	CH <sub>2</sub>	O-C(=O)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	1,2,4-Triazol	163-164
10	351	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	O-C(=O)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	1,2,4-Triazol	81
	352	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	O-C(=O)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	Imidazol	115-116
	353	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Furyl-2	Imidazol	81
	354	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Furyl-2	1,2,4-Triazol	140
	355	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>	Furyl-2	Pyrazol	66
15	356	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Furyl-2	Imidazol	89
	357	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Furyl-2	1,2,4-Triazol	104
	358	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Furyl-2	1,2,4-Triazol	85
	359	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Phenyl	1,2,4-Triazol	104
20	360	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Methyl-phenyl	1,2,4-Triazol	130
	361	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -phenyl	1,2,4-Triazol	108-110
25	362	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -O-C(=O)C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -Cl	1,2,4-Triazol	141
	363	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Thienyl-3	Pyrazol	
	364	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	CH <sub>2</sub>	Thienyl-2	Imidazol	148-149
	365	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> i	CH <sub>2</sub>	Thienyl-2	1,2,4-Triazol	130-131
30	366	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,5-Dimethyl-furyl-3	Pyrazol	90-91
	367	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2,5-Dimethyl-furyl-3	Pyrazol	110-111
	368	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Furyl-3	Imidazol	

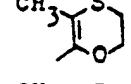
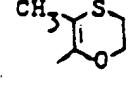
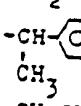
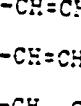
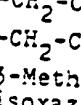
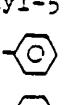
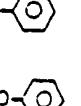
	Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z	R <sup>4</sup>	A	Physikalische Konstante (Pp. °C)
5	369	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	Puryl-3	1,2,4-Triazol	
	370	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	Puryl-3	1,2,4-Triazol	
	371	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Methoxy-phenyl	1,2,4-Triazol	
	372	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3-Methoxy-phenyl	1,2,4-Triazol	
	373	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Methoxy-phenyl	1,2,4-Triazol	
10	374	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	4-Methylthio-phenyl	1,2,4-Triazol	
	375	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2,3-Dichlor-phenyl	1,2,4-Triazol	
	376	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,3-Dichlor-phenyl	1,2,4-Triazol	
	377	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,5-Dichlor-phenyl	1,2,4-Triazol	
	378	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3,5-Dichlor-phenyl	1,2,4-Triazol	
15	379	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	3,5-Dimethyl-phenyl	1,2,4-Triazol	
	380	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Chlorpyridyl-3	1,2,4-Triazol	
	381	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2-Chlorpyridyl-3	1,2,4-Triazol	
	382	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,6-Dichlor-pyridyl-4	Imidazol	120-122
	383	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	2,6-Dichlor-pyridyl-4	1,2,4-Triazol	126-127
20	384	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	2,4-Dichlor-pyrimidyl-5	1,2,4-Triazol	
	385	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		1,2,4-Triazol	
	386	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>		1,2,4-Triazol	
30							

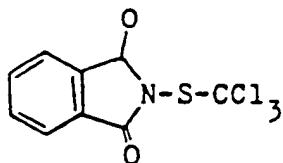
Tabelle V n = 1

Lfd.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Z	R <sup>4</sup>	A	Physikalische Konstante (Fp. °C)	
5								
387	H	CH <sub>3</sub>	5-Cl	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol		
388	H	CH <sub>3</sub>	4-Cl	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol		
389	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i	H	CH <sub>2</sub>	Phenyl	2-Methylimida- zol	133-135	
10	390	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub>	3-NO <sub>2</sub> - phenyl	2-Ethylimida- zol	138-139
391	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Pyrazol	74-76	
392	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>	-CH- 	Imidazol	75-77	
15	393	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>	-CH=CH- 	Imidazol	<sup>n</sup> <sub>D</sub> <sup>22</sup> = 1,5983
394	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>	-CH=CH- 	1,2,4-Triazol	75-76	
395	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -P	Imidazol		
396	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -P	1,2,4-Triazol	89-91	
397	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>	3-Methyl- isoxazo- lyl-5	Imidazol	97-98	
20	398	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>	3-Methyl- isoxazo- lyl-5	1,2,4-Triazol	121-122
399	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub>	O- 	2-Ethylimi- dazol	82-83	
400	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub>	O- 	2-Isopropyl- 4,5-dimethyl- imidazol	81	
25	401	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>	-O- 	2-Methylimi- dazol	98-100

Die neuen Wirkstoffe zeigen eine starke fungitoxische Wirk-  
samkeit gegen phytopathogene Pilze, insbesondere aus der  
Klasse der Phycomyceten. Die neuen Verbindungen sind daher  
beispielsweise geeignet zur Bekämpfung von echten Mehltau-  
5 pilzen und Rostpilzen, z.B. in Getreide, Phytophthora  
infestans an Tomaten und Kartoffeln, Phytophthora parasi-  
tica an Erdbeeren, Phytophthora cactorum an Äpfeln,  
Pseudoperonospora cubensis an Gurken, Pseudoperonospora  
humuli an Hopfen, Peronospora destructor an Zwiebeln,  
10 Peronospora tabacina an Tabak, Plasmopara viticola an Re-  
ben, Plasmopara halstedii an Sonnenblumen, Sclerospora  
macrospora an Mais, Bremia lactucae an Salat, Rhizopus  
nigricans an Rüben. Die fungiziden Mittel enthalten 0,1  
bis 95 % (Gewichtsprozent) Wirkstoff, vorzugsweise 0,5  
15 bis 90 %. Die Aufwandmengen liegen je nach Art des ge-  
wünschten Effektes zwischen 0,1 und 5 kg Wirkstoff je ha.  
Ein Teil der Wirkstoffe zeigt kurative Eigenschaften, d.h.  
die Anwendung der Mittel kann noch nach erfolgter Infektion  
der Pflanzen durch die Krankheitserreger vorgenommen  
20 werden, um einen sicheren Bekämpfungserfolg zu erzielen.  
Darüber hinaus sind viele der neuen Verbindungen systemisch  
wirksam, so daß über die Wurzelbehandlung auch ein Schutz  
oberirdischer Pflanzenteile möglich ist.

25 Als Vergleichsmittel wurde in den folgenden Beispielen  
der bekannte Wirkstoff

30



Verbindung A

verwendet.

35

L

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können auch zusammen mit anderen Wirkstoffen, z.B. Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren und Fungiziden oder auch mit Düngemitteln vermischt und ausgebracht werden. In vielen Fällen erhält man bei der Mischung mit Fungiziden auch eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums; bei einer Anzahl dieser Fungizidmischungen treten auch synergistische Effekte auf, d.h. die fungizide Wirksamkeit des Kombinationsproduktes ist größer als die der addierten Wirksamkeiten der Einzelkomponenten. Eine besonders günstige Vergrößerung des Wirkungsspektrums wird mit folgenden Fungiziden erzielt:

- Manganäthylenbisdithiocarbamat
- Mangan-Zinkäthylenbisdithiocarbamat
- 15 Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-äthylen-bis-dithiocarbamat)
- N-Trichlormethylthio-tetrahydronphthalimid
- N-Trichlormethyl-phthalimid
- 5-Äthoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol
- 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol
- 20 2-Rhodanmethylthiobenzthiazol
- 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol
- 2,3-Dichlor-6-methyl-1,4-oxathiin-5-carbonsäureanilid
- 2-Methyl-5,6-dihydro-4-H-pyran-3-carbonsäure-anilid
- 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid
- 25 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid
- 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid
- N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäure-amid
- 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-
- 30 -oxazolidin
- 3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxazolidin-2,4-dion

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen kombiniert werden können, soll die

Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken.

5 Fungizide, die mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen kombiniert werden können, sind beispielsweise:

Dithiocarbamate und deren Derivate, wie

Ferridimethyldithiocarbamat

Zinkdimethyldithiocarbamat

10 Zinkäthylenbisdithiocarbamat

Tetramethylthiuramdisulfide

Zink-(N,N-propylen-bis-dithiocarbamat)

Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat) und

15 N,N'-Polypropylen-bis-(thiocarbamoyl)-disulfid

Nitroderivate, wie

Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat

2-sec.-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat

20 2-sec.-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat

heterocyclische Strukturen, wie

2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat

2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin

25 0,O-Diäthyl-phthalimidophonothioat

5-Amino-1-(bis-(dimethylamino)-phosphinyl)-3-phenyl-1,2,4-triazol

2,3-Dicyano-1,4-dithiaanthrachinon

2-Thio-1,3-dithio-(4,5-b)-chinoxalin

30 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester

4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazolon

Pyridin-2-thio-1-oxid

8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz

35 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid

2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin  
 2-(Furyl-(2))-benzimidazol  
 Piperazin-1,4-diylbis-(1-(2,2,2-trichlor-äthyl)-formamid  
 2-(Thiazolyl-(4)-benzimidazol  
 5 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin  
 Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol  
 1,2-Bis-(3-äthoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol  
 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol  
 sowie verschiedene Fungizide, wie  
 10 Dodecylguanidinacetat  
 3-(3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyäthyl)-glutar-imid  
 Hexachlorbenzol  
 N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefel-säurediamid  
 15 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid  
 2-Methyl-benzoësäure-anilid  
 2-Jod-benzoësäure-anilid  
 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichloräthan  
 20 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze  
 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze  
 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon  
 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-25  
 -2-butanol  
 $\alpha$ -(2-Chlorphenyl)- $\alpha$ -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol.

Die neuen Wirkstoffe werden beispielsweise in Form von  
 direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch  
 30 hochprozentige wässrige, ölige oder sonstige Suspensionen  
 oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten,  
 Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen,  
 Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet.  
 Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungs-  
 35 zwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste  
 Verteilung der neuen Wirkstoffe gewährleisten.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten und Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle usw., sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, zum Beispiel Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate z.B. Methanol, Äthanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff,

5 lichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, zum Beispiel Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate z.B. Methanol, Äthanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff,  
 10 Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron usw., stark polare Lösungsmittel, wie z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser usw. in Betracht.

15 Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulvern), Öldispersionen durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen in Betracht:

Aalkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfinsäure, Naphthalinsulfinsäuren, Phenolsulfinsäure, Alkylarylsulfate,

30 Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Alkali- und Erdalkali- salze der Dibutylnaphthalinsulfinsäure, Lauryläthersulfat,

Fettalkoholsulfat, fettsaure Alkali- und Erdalkali- salze sulfatierter Hexacessäure, undadecanole, ..., ...

35 Salze von Alkali- und Erdalkali- Salzen der Naphthalinsulfinsäure, ...

1 Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyäthylen-octylphenoläther, äthoxyliertes Isooctylphenol-, Octylphenol-, Nonylphenol,

5 Alkylphenolpolyglykoläther, Tributylphenylpolyglykoläther, Alkalarylpolyätheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholäthylenoxid-Kondensate, äthoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyäthylenalkyläther, äthoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykolätheracetal, Sorbitester, Lignin,

10 Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Pulver, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

15 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerde wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kreide, Talkum, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie

20 25 Getreidemehle, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Beispiel 4

30 Fungizide Wirksamkeit gegen *Plasmopara viticola* an Reben

Blätter von Topfreben der Sorte Müller-Thurgau werden mit wässrigen Dispersionen, die 80 % (Gew.%) des zu prüfenden Wirkstoffes und 20 % Natriumligninsulfonat in der Trocken-  
35 substanz enthalten, besprüht. Es werden 0,1- und 0,05 %ige

Spritzbrühen (bezogen auf die Trockensubstanz) verwendet. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages werden die Blätter mit einer Zoosporenaufschwemmung von *Plasmopara viticola* infiziert. Die Pflanzen kommen dann zuerst für 16 Stunden 5 in eine wasserdampfgesättigte (feuchte) Kammer bei 20°C und anschließend 8 Tage in ein Gewächshaus mit Temperaturen zwischen 20 und 30°C. Nach dieser Zeit werden die Pflanzen zur Beschleunigung und Verstärkung des Sporangienträgerausbruches abermals während 16 Stunden in der feuchten 10 Kammer aufgestellt. Dann erfolgt die Beurteilung des Blattbefalls auf den Blattunterseiten. Als Vergleich dienen unbehandelte infizierte Kontrollpflanzen.

15

20

25

30

35

0013360

BASF Aktiengesellschaft

- 39 -

O.Z. 0050/033579

0 kein Befall, abgestuft bis 5 Totalbefall

5	Wirkstoff	Blattbefall nach Spritzung mit	
		... ziger Spritzbrühe 0,1	0,05
	178	1	2
	179	1	2
	183	1	2
	189	1	2
10	194	1	2
	196	1	2
	197	1	2
	199	0	1
	201	0	0
15	204	1	2
	240	0	1
	244	1	2
	246	1	2
	250	1	2
20	256	0	0
	262	0	0
	276	0	1
	277	0	1
	298	1	2
25	302	0	0
	304	0	0
	347	0	1
	373	1	2
	374	1	2
30	A (bekannt)	2	3
	Kontrolle	5	
	(unbehandelt)		

Beispiel 5

Fungizide Wirksamkeit gegen Phytophthora infestans an Tomaten

5

Blätter von Tomatenpflanzen der Sorte "Professor Rudloff" werden mit wässrigen Suspensionen, die 80 % (Gew.-%) des zu prüfenden Wirkstoffes und 20 % Natriumligninsulfonat in der Trockensubstanz enthalten, besprüht. Es wird eine

10

0,1 %ige Spritzbrühe (berechnet auf die Trockensubstanz) verwendet. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages werden die Blätter mit einer Zoosporenaufschwemmung des Pilzes Phytophthora infestans infiziert. Die Pflanzen werden dann in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 16 und 18°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hat sich die Krankheit auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, daß die fungizide Wirksamkeit der Substanzen beurteilt werden kann.

15

20

0 kein Befall, abgestuft bis 5 Totalbefall (Kontrolle)

Wirkstoff

Befall der Blätter nach Spritzung mit 0,1 %iger Spritzbrühe

25

189	2
200	2
201	2
250	2
256	0
261	1
270	0
276	2
316	0
332	1
365	0
368	1
395	1
Kontrolle (unbehandelt)	5

30

35

Beispiel 6

Man vermischt 90 Gewichtsteile der Verbindung 1 mit 10 Gewichtsteilen N-Methyl- $\alpha$ -pyrrolidon und erhält eine 5 Mischung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist.

Beispiel 7

10 20 Gewichtsteile der Verbindung 2 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Xylol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Äthylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-mono-äthanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Äthylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gewichtsprozent des Wirkstoffs enthält.

15 20

Beispiel 8

20 Gewichtsteile der Verbindung 2 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Äthylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Äthylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gewichtsprozent des Wirkstoffs enthält.

25 30

Beispiel 9

35 20 Gewichtsteile der Verbindung 2 werden in einer Mischung

gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanol, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Äthylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gewichtsprozent des Wirkstoffs enthält.

Beispiel 10

10

20 Gewichtsteile des Wirkstoffs 2 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- $\alpha$ -sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfinsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gewichtsprozent des Wirkstoffs enthält.

20 Beispiel 11

3 Gewichtsteile der Verbindung 1 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gewichtsprozent des Wirkstoffs enthält.

Beispiel 12

30 Gewichtsteile der Verbindung 2 werden mit einer Mischung aus 92 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gewichtsteilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprührt wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit.

35

*BAD ORIGINAL*

Beispiel 13

40 Gewichtsteile des Wirkstoffs 1 werden mit 10 Teilen Natriumsalz eines Phenolsulfonsäure-Harnstoff-Formaldehyd-5-Kondensats, 2 Teilen Kieselgel und 48 Teilen Wasser innig vermischt. Man erhält eine stabile wässrige Dispersion. Durch Verdünnen mit 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,04 Gewichtsprozent Wirkstoff enthält.

10

Beispiel 14

20 Teile des Wirkstoffs 2 werden mit 2 Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Teilen Fettalkohol-poly-15 glykoläther, 2 Teilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensats und 68 Teilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.

20

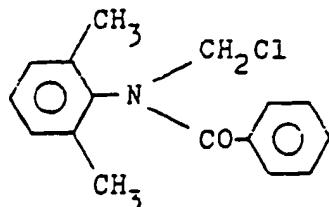
Beispiel 15

a) Man löst 140,5 g (1 Mol) Benzoylchlorid in 200 ml Ligroin und tropft anschließend bei 5 bis 10°C eine Lösung von 133 g (1 Mol) N-Methylen-2,6-dimethylanilin in 25 Toluol zu. Nach 14 Stunden Rühren bei 25°C wird der ausgefallene Feststoff durch Absaugen isoliert. Nach Trocknen im Vakuum erhält man 215 g (79 %) N-Chlor-methyl-N-benzoyl-2,6-dimethylanilin mit Fp. 133°C, Formel:

30

35

5

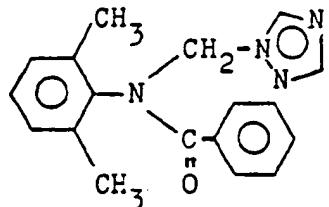


In analoger Weise wurde N-Chlormethyl-N-benzoyl-2,6-diäthylanilin vom Fp. 98 bis 99°C erhalten.

10 b) Eine Lösung von 54,7 g (0,2 Mol) N-Chlormethyl-N-benzoyl-2,6-dimethylanilin in 250 ml Tetrahydrofuran wird bei 5 bis 10°C zu einer Suspension von 13,8 g (0,2 Mol) Triazol in 100 ml Tetrahydrofuran und 20,2 g (0,2 Mol) Triäthylamin zugetropft. Nach 16 Stunden Rühren bei Raumtemperatur (25°C) wird vom abgeschiedenen Triäthyl-ammoniumhydrochlorid abfiltriert. Nach Abziehen des Lösungsmittels wird der aus dem Filtrat isolierte Feststoff in 250 ml  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  gelöst und mit 100 ml 5 %iger (Gew.-%) Salzsäure ausgeschüttelt. Die organische Phase wird nach Trocknung über  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  eingeengt; der verbleibende Rückstand wird aus Toluol/Ligroin (3 : 2) umkristallisiert.

25 Man erhält 44,6 g (73 %) N-(Triazolylmethyl)-N-benzoyl-2,6-dimethylanilin der Formel

30



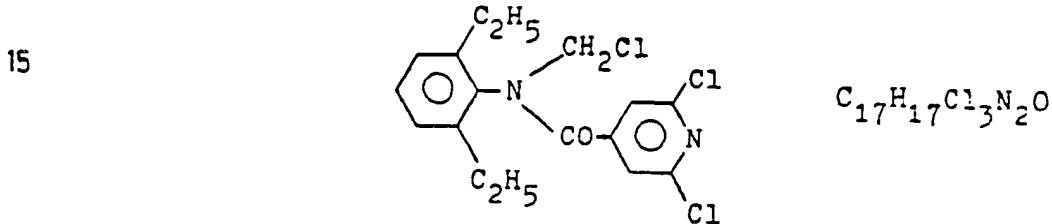
mit Schmelzpunkt 135°C.

35

In gleicher Weise wurde N-(Triazolylmethyl)-N-benzoyl-2,6-diäthylanilin hergestellt, Fp. 112-115°C.

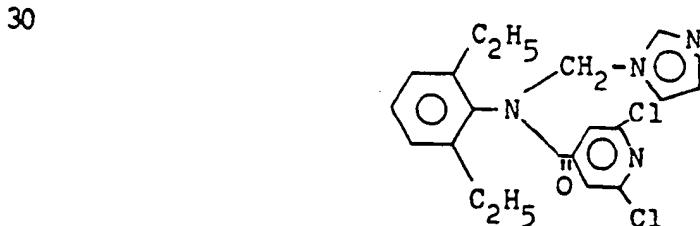
Beispiel 16

5 a) Zu einer Lösung von 51,4 g (0,24 Mol) 2,6-Dichlor-pyridin-4-carbonsäurechlorid in 250 ml Toluol tropft man 38,6 g (0,24 Mol) N-Methylen-2,6-diäthylanilin. Durch Kühlung mit einem Wasserbad wird die Reaktions-temperatur bei 35-40°C gehalten. Nach 10-stündigem Rühren wird das Toluol im Vakuum abgezogen (Rotations-verdampfer) und der verbleibende Rückstand mit Ligroin durchgerührt. Man erhält nach Absaugen und Trocknen 10 67 g (75 %) des N-Chlormethylanilids folgender Struktur mit Schmelzpunkt 79-80°C.



20 b) Eine Mischung aus 22,3 g (0,06 Mol) dieses N-Chlormethylanilids und 9 g (0,132 Mol) Imidazol in 100 ml Toluol wird 1 Stunde am Rückflußkühler zum Sieden erhitzt. Anschließend wird heiß filtriert. Nach Abkühlen des Filtrats isoliert man daraus einen Feststoff, der aus einer 1 : 1-Mischung von Ligroin und Toluol umkristallisiert wird.

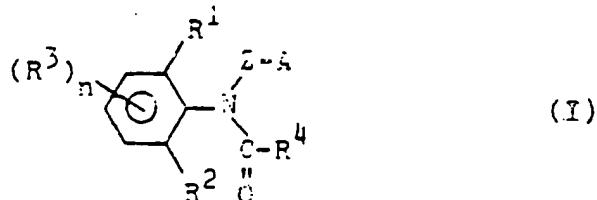
25 Ausbeute nach Umkristallisation: 11 g (46 %)  
Schmelzpunkt: 120-122°C.



Patentansprüche

## 1. N-substituiertes Carbonsäureanilid der Formel

5



10

worin

$R^1$  Wasserstoff,  $C_1-C_4$ -Alkyl,  $C_1-C_3$ -Alkoxy oder Halogen,

$R^2$  Wasserstoff,  $C_1-C_4$ -Alkyl oder Halogen,

$R^3$  Methyl oder Chlor,

$R^4$  gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen substituiertes  $C_1-C_5$ -Alkyl,  $C_2-C_4$ -Alkenyl, gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen im Phenylring substituiertes Styryl,

$C_3-C_6$ -Cycloalkyl, Zentyl oder 1-Phenyläthyl außer Monohalogenacetyl bedeutet

oder  $R^4$  gegebenenfalls durch Methyl, Fluor, Chlor, Brom, Jod, Cyan, Nitro, Trifluormethyl,

Methoxy oder Methylthio, ein- oder zweifach substituiertes Phenyl, oder einen gegebenenfalls

durch Methyl oder Halogen substituierten 5- oder 6gliedrigen heterocyclischen Rest mit 1 oder 2 Heteroatomen bedeutet

20

oder  $R^4$  den Rest  $-\overset{\overset{CH_3}{|}}{CH_2}-Y$  oder  $-\overset{\overset{CH_3}{|}}{CH}-Y$  bedeutet,

wobei  $Y$   $C_1-C_7$ -Alkoxy,  $C_1-C_4$ -Alkylthio,

oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Chlor, Methyl oder Trifluormethyl substituierten Phenoxy oder Phenylthio bedeutet,

oder  $R^4$  den Rest  $-\overset{\overset{X}{|}}{CH}-R$  bedeutet, wobei

$X$  Sauerstoff oder Schwefel und

25

30

35

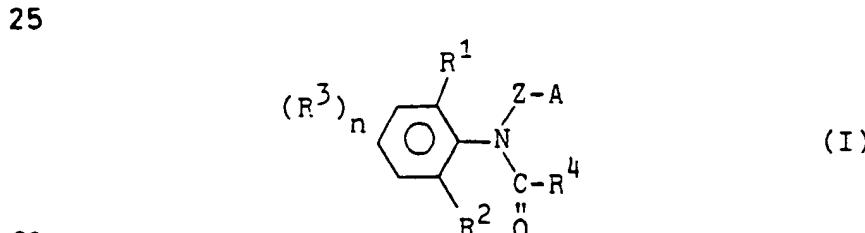
5            $R^5$   $C_1-C_6$ -Alkyl, Cyclohexyl oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Methyl, Nitro, Äthyl, Isopropyl, tert.-Butyl, Methoxy oder Methylthio substituiertes Phenyl bedeutet,

10           z       die Reste  $-CH_2-$ ,  $-CH_2-(CH_2)_m-$ ,  $-CH_2-CH-$  oder  $\overset{CH_3}{CH_2}-$  bedeutet,  
 $\overset{CH_3}{CH_2}$   
 $m$  1 oder 2 bedeutet und

15           A       gegebenenfalls durch Methyl, Äthyl, Isopropyl, Nitro, Chlor oder Brom ein- oder mehrfach substituiertes Pyrazol, Imidazol oder 1,2,4-Triazol bedeutet und

20           n       0, 1 oder 2 bedeutet,  
sowie deren Säureadditionsprodukte und Metallsalzkomplexverbindungen.

25           2. Fungizid, enthaltend ein N-substituiertes Carbonsäureanilid der Formel



worin

35            $R^1$     Wasserstoff,  $C_1-C_4$ -Alkyl,  $C_1-C_3$ -Alkoxy oder Halogen,  
 $R^2$     Wasserstoff,  $C_1-C_4$ -Alkyl oder Halogen,

5       $R^3$       Methyl oder Chlor,  
 10      $R^4$       gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen  
        substituiertes  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_4$ -Alkenyl,  
        gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Halo-  
        gen im Phenylring substituiertes Styryl,  
         $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl, Benzyl oder 1-Phenyläthyl  
        außer Monohalogenacetyl bedeutet  
        oder  $R^4$  gegebenenfalls durch Methyl, Fluor,  
        Chlor, Brom, Jod, Cyan, Nitro, Trifluormethyl,  
 15     Methoxy oder Methylthio, ein- oder zweifach  
        substituiertes Phenyl, oder einen gegebenenfalls  
        durch Methyl oder Halogen substituierten 5- oder  
        6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit 1 oder 2  
        Heteroatomen bedeutet  
 20     15  
        oder  $R^4$  den Rest  $-CH_2-Y$  oder  $-CH-Y$  bedeutet,  
        wobei Y  $C_1$ - $C_7$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  
        oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch  
        Chlor, Methyl oder Trifluormethyl substituiertes  
        Phenoxyl oder Phenylthio bedeutet,  
 25     20  
        oder  $R^4$  den Rest  $-X-R^5$  bedeutet, wobei  
        X Sauerstoff oder Schwefel und  
         $R^5$   $C_1$ - $C_6$ -Alkyl, Cyclohexyl oder gegebenenfalls  
        ein- oder mehrfach durch Fluor, Chlor, Brom,  
        Trifluormethyl, Methyl, Nitro, Äthyl, Isopropyl,  
        tert.-Butyl, Methoxy oder Methylthio substitu-  
        iertes Phenyl bedeutet,  
 30     25  
        3      die Reste  $-CH_2-$ ,  $-CH_2-(CH_2)_m-$ ,  $-CH_2-CH-$  oder  
         $CH_3$   
         $-CH-CH_2-$  bedeutet,  
         $CH_3$   
        m 1 oder 2 bedeutet und

A gegebenenfalls durch Methyl, Athyl, Isopropyl, Nitro, Chlor oder Brom ein- oder mehrfach substituiertes Pyrazol, Imidazol oder 1,2,4-Triazol bedeutet und

5

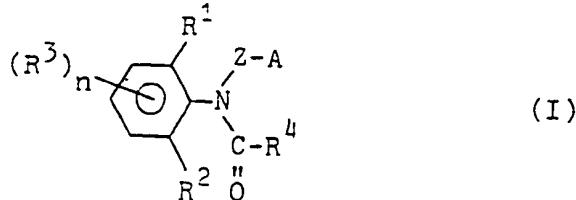
n 0, 1 oder 2 bedeutet,

sowie deren Säureadditionsprodukte und Metallsalzkomplexverbindungen.

10

3. Fungizid, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und ein N-substituiertes Carbonsäureanilid der Formel

15



20

worin

R<sup>1</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy oder Halogen,

R<sup>2</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen,

R<sup>3</sup> Methyl oder Chlor,

R<sup>4</sup> gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Halogen im Phenylring substituiertes Styryl,

30 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Benzyl oder 1-Phenyläthyl außer Monohalogenacetyl bedeutet

oder R<sup>4</sup> gegebenenfalls durch Methyl, Fluor, Chlor, Brom, Jod, Cyan, Nitro, Trifluormethyl, Methoxy oder Methylthio, ein- oder zweifach

35 substituiertes Phenyl, oder einen gegebenenfalls durch Methyl oder Halogen substituierten 5- oder

6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit 1 oder 2 Heteroatomen bedeutet

5                   oder R<sup>4</sup> den Rest -CH<sub>2</sub>-Y oder -CH<sup>3</sup>-Y bedeutet, wobei Y C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Arylthio, oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Chlor, Methyl oder Trifluormethyl substituiertes Phenoxy oder Phenylthio bedeutet,

10                  oder R<sup>4</sup> den Rest -X-R<sup>5</sup> bedeutet, wobei X Sauerstoff oder Schwefel und R<sup>5</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Cyclohexyl oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Methyl, Nitro, Äthyl, Isopropyl, tert.-Butyl, Methoxy oder Methylthio substituiertes Phenyl bedeutet,

15                  Z            die Reste -CH<sub>2</sub>- , -CH<sub>2</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>- , -CH<sub>2</sub>-CH<sup>3</sup>- oder -CH<sup>3</sup>-CH<sub>2</sub>- bedeutet,

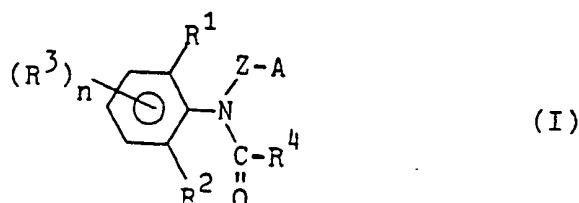
20                  m 1 oder 2 bedeutet und

25                  A            gegebenenfalls durch Methyl, Äthyl, Isopropyl, Nitro, Chlor oder Brom ein- oder mehrfach substituiertes Pyrazol, Imidazol oder 1,2,4-Triazol bedeutet und

30                  n            C, 1 oder 2 bedeutet, sowie deren Säureadditionsprodukte und Metallsalzkomplexverbindungen.

4. Verfahren zur Herstellung eines Fungizides, dadurch gekennzeichnet, daß man einen festen oder flüssigen Trägerstoff vermischt mit einem N-substituierten Carbonsäureanilid der Formel

5



10

worin

15  $R^1$  Wasserstoff,  $C_1-C_4$ -Alkyl,  $C_1-C_3$ -Alkoxy oder Halogen,

$R^2$  Wasserstoff,  $C_1-C_4$ -Alkyl oder Halogen,

$R^3$  Methyl oder Chlor,

$R^4$  gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen substituiertes  $C_1-C_6$ -Alkyl,  $C_2-C_4$ -Alkenyl, gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Halogen im Phenylring substituiertes Styryl,

$C_3-C_6$ -Cycloalkyl, Benzyl oder 1-Phenyläthyl außer Monohalogenacetyl bedeutet

oder  $R^4$  gegebenenfalls durch Methyl, Fluor, Chlor, Brom, Jod, Cyan, Nitro, Trifluormethyl,

Methoxy oder Methylthio, ein- oder zweifach substituiertes Phenyl, oder einen gegebenenfalls durch Methyl oder Halogen substituierten 5- oder 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit 1 oder 2 Heteroatomen bedeutet

20

25

30

35

oder  $R^4$  den Rest  $-CH_2-Y$  oder  $-CH_3$ -Y bedeutet, wobei Y  $C_1-C_7$ -Alkoxy,  $C_1-C_4$ -Alkylthio,

oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Chlor, Methyl oder Trifluormethyl substituiertes Phenoxy oder Phenylthio bedeutet,

oder  $R^4$  den Rest  $-X-R^5$  bedeutet, wobei

5

X Sauerstoff oder Schwefel und  
 $R^5 C_1-C_6$ -Alkyl, Cyclohexyl oder gegebenenfalls  
 ein- oder mehrfach durch Fluor, Chlor, Brom,  
 Trifluormethyl, Methyl, Nitro, Äthyl, Isopropyl,  
 tert.-Butyl, Methoxy oder Methyltric substitu-  
 iertes Phenyl bedeutet,

10

Z die Reste  $-CH_2-$ ,  $-CH_2-(CH_2)_m-$ ,  $-CH_2-CH-$  oder  
 $CH_3$   
 $-CH-CH_2-$  bedeutet,  
 $CH_3$   
 $m$  1 oder 2 bedeutet und

15

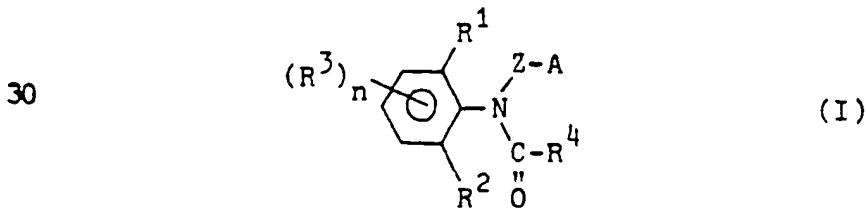
A gegebenenfalls durch Methyl, Äthyl, Isopropyl,  
 Nitro, Chlor oder Brom ein- oder mehrfach substi-  
 tiertes Pyrazol, Imidazol oder 1,2,4-Triazol  
 bedeutet und

20

n 0, 1 oder 2 bedeutet,  
 sowie deren Säureadditionsprodukte und Metallsalzkom-  
 plexverbindungen.

25

5. Verfahren zur Bekämpfung von Pilzen, dadurch gekenn-  
zeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall  
 zu schützenden Gegenstände behandelt mit einem N-sub-  
 stituierteren Carbonsäureanilid der Formel



35

worin

R<sup>1</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy oder  
 Halogen,  
 R<sup>2</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen,  
 R<sup>3</sup> Methyl oder Chlor,  
 5 R<sup>4</sup> gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen  
 substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl,  
 gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Halo-  
 gen im Phenylring substituiertes Styryl,  
 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Benzyl oder 1-Phenyläthyl  
 10 außer Monohalogenacetyl bedeutet  
 oder R<sup>4</sup> gegebenenfalls durch Methyl, Fluor,  
 Chlor, Brom, Jod, Cyan, Nitro, Trifluormethyl,  
 Methoxy oder Methylthio, ein- oder zweifach  
 substituiertes Phenyl, oder einen gegebenenfalls  
 15 durch Methyl oder Halogen substituierten 5- oder  
 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit 1 oder 2  
 Heteroatomen bedeutet  
 oder R<sup>4</sup> den Rest -CH<sub>2</sub>-Y oder -CH-Y bedeutet,  
 20 wobei Y C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio,  
 oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch  
 Chlor, Methyl oder Trifluormethyl substituiertes  
 Phenoxy oder Phenylthio bedeutet,  
 oder R<sup>4</sup> den Rest -X-R<sup>5</sup> bedeutet, wobei  
 25 X Sauerstoff oder Schwefel und  
 R<sup>5</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Cyclohexyl oder gegebenenfalls  
 ein- oder mehrfach durch Fluor, Chlor, Brom,  
 Trifluormethyl, Methyl, Nitro, Äthyl, Isopropyl,  
 tert.-Butyl, Methoxy oder Methylthio substitu-  
 iertes Phenyl bedeutet,  
 30 Z die Reste -CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH- oder  
 -CH-CH<sub>2</sub>- bedeutet,  
 35 m 1 oder 2 bedeutet und

A gegebenenfalls durch Methyl, Äthyl, Isopropyl, Nitro, Chlor oder Brom ein- oder mehrfach substituiertes Pyrazol, Imidazol oder 1,2,4-Triazol bedeutet und

5

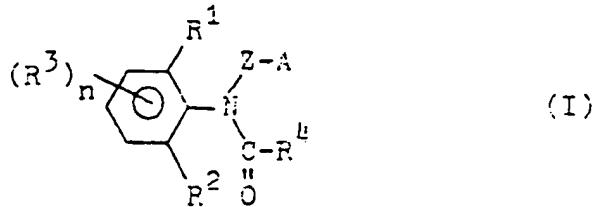
n 0, 1 oder 2 bedeutet,

sowie deren Säureadditionsprodukte und Metallsalzkomplexverbindungen.

10

6. Verfahren zur Herstellung eines N-substituierten N-Carbonsäureanilids der Formel

15



20

worin

R<sup>1</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy oder Halogen,

R<sup>2</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen,

R<sup>3</sup> Methyl oder Chlor,

R<sup>4</sup> gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl,

gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Halogen im Phenylring substituiertes Styryl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Benzyl oder 1-Phenyläthyl

außer Monohalogenacetyl bedeutet

oder R<sup>4</sup> gegebenenfalls durch Methyl, Fluor, Chlor, Brom, Jod, Cyan, Nitro, Trifluormethyl,

Methoxy oder Methylthio, ein- oder zweifach substituiertes Phenyl, der einen gegebenenfalls durch Methyl oder Halogen substituierten 5- oder

6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit 1 oder 2

30

35



### Heteroatomen bedeutet

5

$\text{CH}_3$   
 oder  $\text{R}^4$  den Rest  $-\text{CH}_2\text{-Y}$  oder  $-\text{CH}\text{-Y}$  bedeutet,  
 wobei Y  $\text{C}_1\text{-C}_7$ -Alkoxy,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Alkylthio,  
 oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch  
 Chlor, Methyl oder Trifluormethyl substituiertes  
 Phenoxy oder Phenylthio bedeutet,  
 oder  $\text{R}^4$  den Rest  $-\text{X-R}^5$  bedeutet, wobei  
 X Sauerstoff oder Schwefel und  
 $\text{R}^5$   $\text{C}_1\text{-C}_6$ -Alkyl, Cyclohexyl oder gegebenenfalls  
 ein- oder mehrfach durch Fluor, Chlor, Brom,  
 Trifluormethyl, Methyl, Nitro, Äthyl, Isopropyl,  
 tert.-Butyl, Methoxy oder Methylthio substitu-  
 iertes Phenyl bedeutet,

10

den Rest  $\text{CH}_2$  bedeutet,

20

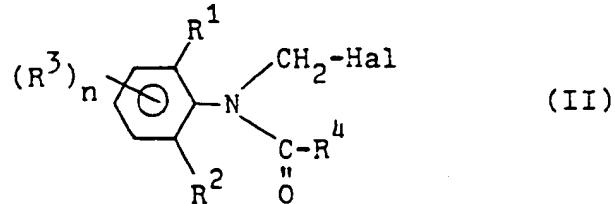
A gegebenenfalls durch Methyl, Äthyl, Isopropyl, Nitro, Chlor oder Brom ein- oder mehrfach substituiertes Pyrazol, Imidazol oder 1,2,4-Triazol bedeutet und

n = 0, 1 oder 2 bedeutet,

25

sowie deren Säureadditionsprodukte und Metallsalzkomplexverbindungen, dadurch gekennzeichnet, daß man 1 Mol eines N-Halogenmethylcarbonsäureanilids der Formel

30



35

in welcher  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  und  $R^4$  und  $n$  die oben angegebene Bedeutung haben, und Halogen, insbesondere Chlor oder Brom bedeutet, mit 1 bis 2 Mol eines Azols der Formel

5

A-M (III)

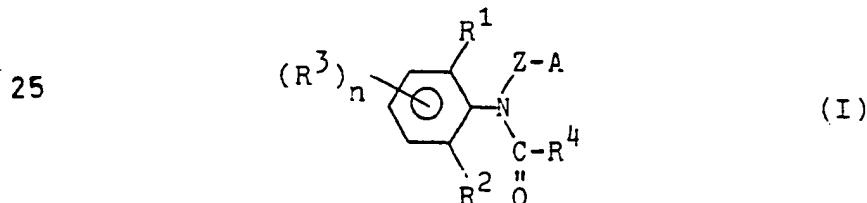
in welcher

10 A die oben angegebene Bedeutung hat und  
 $M$  Wasserstoff oder ein Alkalimetall bedeutet, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart von 1,1 bis 1,3 Mol eines Säurebindemittels bei einer Temperatur zwischen -10 und +150°C umsetzt und gegebenenfalls an die so erhaltene Verbindung anschließend eine Säure oder ein Metallsalz addiert.

15

7.  $N$ -substituiertes Carbonsäureanilid, hergestellt gemäß dem vorhergehenden Patentanspruch.

20 8. Verfahren zur Herstellung eines  $N$ -substituierten Carbonsäureanilids der Formel



30 worin

$R^1$  Wasserstoff,  $C_1-C_4$ -Alkyl,  $C_1-C_3$ -Alkoxy oder Halogen,

$R^2$  Wasserstoff,  $C_1-C_4$ -Alkyl oder Halogen,

$R^3$  Methyl oder Chlor;

35

BAD ORIGINAL

4  $R^4$  gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen substituiertes  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_4$ -Alkenyl, gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Halogen im Phenylring substituiertes Styryl,  
 5  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl, Benzyl oder 1-Phenyläthyl außer Monohalogenacetyl bedeutet  
 oder  $R^4$  gegebenenfalls durch Methyl, Fluor, Chlor, Brom, Jod, Cyan, Nitro, Trifluormethyl, Methoxy oder Methylthio, ein- oder zweifach substituiertes Phenyl, oder einen gegebenenfalls durch Methyl oder Halogen substituierten 5- oder 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit 1 oder 2 Heteroatomen bedeutet

10 oder  $R^4$  den Rest  $-\overset{CH_3}{CH_2}-Y$  oder  $-\overset{CH_3}{CH}-Y$  bedeutet, wobei Y  $C_1$ - $C_7$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio, oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Chlor, Methyl oder Trifluormethyl substituiertes Phenoxy oder Phenylthio bedeutet,  
 15 oder  $R^4$  den Rest  $-X-R^5$  bedeutet, wobei X Sauerstoff oder Schwefel und  $R^5$   $C_1$ - $C_6$ -Alkyl, Cyclohexyl oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Methyl, Nitro, Äthyl, Isopropyl, tert.-Butyl, Methoxy oder Methylthio substituiertes Phenyl bedeutet,

20 oder  $R^4$  den Rest  $-(CH_2)_2-$ ,  $-(CH_2)_3-$ ,  $-\overset{CH_3}{CH}-CH_2-$ , oder

25  $-\overset{CH_2}{CH_2}-CH-\overset{CH_3}{CH_3}$  bedeutet,

Z den Rest  $-(CH_2)_2-$ ,  $-(CH_2)_3-$ ,  $-\overset{CH_3}{CH}-CH_2-$ , oder

30  $-\overset{CH_2}{CH_2}-CH-\overset{CH_3}{CH_3}$  bedeutet,

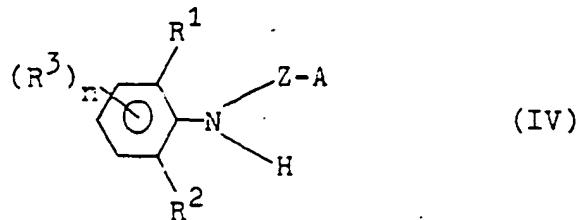
A gegebenenfalls durch Methyl, Äthyl, Isopropyl, Nitro, Chlor oder Brom ein- oder mehrfach substituiertes Pyrazol, Imidazol oder 1,2,4-Triazol bedeutet und

L

n = 0, 1 oder 2 bedeutet,

5 sowie deren Säureadditionsprodukte und Metallsalzkomplexverbindungen, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Mol eines sekundären Anilins der Formel

10



15

in welcher R¹, R², R³, A, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben, mit 1 bis 1,2 Mol eines Carbonsäurehalogenids der Formel



20

bei einer Temperatur zwischen -10 und +150°C umsetzt, in welcher Hal Halogen, insbesondere Fluor, Chlor oder Brom bedeutet, und R⁴ die oben angegebene Bedeutung hat.

25

9. N-substituiertes Carbonsäureanilid, hergestellt gemäß dem vorhergehenden Patentanspruch.

10. N-1,2,4-Triazolyl-(1)-methyl-methoxyacetyl-2,6-dimethylanilid.

30

11. Fungizid, enthaltend N-1,2,4-Triazolyl-(1)-methyl-methoxyacetyl-2,6-dimethylanilid.

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**